

第I欄 報告の基礎

1. 言語に関し、この予備審査報告は以下のものを基礎とした。

- ☒ 出願時の言語による国際出願
☐ 出願時の言語から次の目的のための言語である _____ 語に翻訳された、この国際出願の翻訳文
☐ 国際調査 (PCT規則12.3(a)及び23.1(b))
☐ 国際公開 (PCT規則12.4(a))
☐ 国際予備審査 (PCT規則55.2(a)又は55.3(a))

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 _____ ページ、出願時に提出されたもの
 第 _____ ページ*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ ページ*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 _____ 項、出願時に提出されたもの
 第 _____ 項*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの
 第 _____ 項*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ 項*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____ ページ/図、出願時に提出されたもの
 第 _____ ページ/図*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ ページ/図*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記書類が削除された。

☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性(N)	請求の範囲 1-3	有
	請求の範囲	無
進歩性(IS)	請求の範囲	有
	請求の範囲 1-3	無
産業上の利用可能性(IA)	請求の範囲 1-3	有
	請求の範囲	無

2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

文献1: WO 00/50395 A1 (エーザイ株式会社) 2000.08.31

文献2: JP 9-316053 A (エーザイ株式会社) 1997.12.09

文献3: 日本化学会編, 実験化学講座2基礎技術II, 第3版第2刷, 1967年12月10日,
丸善株式会社発行, 第81頁

文献4: WO 02/59092 A1 (MERCK PATENT GESELLSCHAFT MIT BESCHRAENKTER HAFTUNG)
2002.08.01

[1] 請求の範囲1及び3に記載された発明は、国際調査報告で引用された上記文献1、2と、新たに引用する文献3により進歩性を有しない。

文献1には、式(3a)で表されるアミノインドール誘導体と、式A-SO₂C1で表されるスルホンクロライド誘導体とを塩基存在下、テトラヒドロフラン溶媒中に反応させる、式(5a)で表されるスルホンアミド基含有インドール誘導体の製造方法が記載されており、請求項1及び3に係る方法は、反応溶媒が、水及び酢酸アルキルエステルの混合溶媒である点で、これと相違する(文献1第25-32頁参照)。

一方、文献2には、アミノインドール誘導体とスルホンクロライド誘導体を反応させる際に、水及び酢酸アルキルエステルの存在下、反応を行う方法が記載されているから(第9欄第23行-第10欄第18行参照)、文献1の反応方法において、過酸化物を生ずる傾向のある溶媒であるテトラヒドロフランに替えて(要すれば文献3第81頁エーテルの項参照)、同様の反応に用いる他の溶媒を採用してみることは、当業者が容易に行い得ることである。

また、反応溶媒や反応条件を実験的に好適化してみる程度のことは当業者が容易に行い得ることであって、請求項1及び3に係る製造方法の奏する効果を予測し得ない程のものとするともできない。

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V 欄の続き

[2] 請求の範囲 2 に記載された発明は、上記文献 1-3 と、新たに引用する文献 4 により進歩性を有しない。

上記 [1] 参照。

文献 1 には、式 (1 a) で表されるニトロインドール誘導体をジメチルホルムアミド中、オキシハロゲン化リンと反応させ、生成物を単離した後、ヒドロキシルアミン塩酸塩を加え反応させ、式 (2 a) で表わされるシアノ化体とし、次いでその化合物 (2 a) を還元反応に付し、式 (3 a) で表わされるアミノインドール誘導体を得る方法が記載されており、請求項 2 に係る方法は、ホルミル化反応及びシアノ化反応をワンポットで行う点で、これと相違する (文献 1 第 7 頁、第 15 頁、第 17 頁参照)。

一方、文献 4 には、インドール誘導体を、ジメチルホルムアミド中、オキシハロゲン化リンと反応させ、ヒドロキシルアミン塩酸塩を加え反応させ、シアノ化する反応が記載されており、当該ホルミル化とシアノ化はワンポットで行い得ることも記載されているから (第 6-7 頁、第 23-24 頁参照)、文献 1 の反応方法において、工程の簡略化を目的として、これを採用してみることは当業者が容易に行い得ることである。

そして、請求項 2 に係る製造方法の奏する効果を、予測し得ない程のものとすることもできない。